

## ABSTRACT

It is intended to provide a pyrrole-imidazole polyamide type functional molecule having enhanced abilities of alkylating DNA and recognizing a sequence, compared with the existing functional molecules of this type, for a specific base sequence occurring on DNA. A hairpin polyamide having an alkylation site via a vinyl linker at the end of a pyrrole-imidazole polyamide. Drugs for inhibiting the expression of a specific gene and anticancer agents containing the above hairpin polyamide.

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2003 年 9 月 18 日 (18.09.2003)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 03/076412 A1(51) 国際特許分類: C07D 233/90, 403/14,  
487/04, A61K 31/4178, A61P 35/00, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP03/02423

(22) 国際出願日: 2003 年 3 月 3 日 (03.03.2003)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2002-63608 2002 年 3 月 8 日 (08.03.2002) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 科学技術  
振興事業団 (JAPAN SCIENCE AND TECHNOLOGY  
CORPORATION) [JP/JP]; 〒332-0012 埼玉県 川口市  
本町四丁目 1 番 8 号 Saitama (JP).代田区 四番町 8-6 1 1 号 Tokyo (JP). 板東 俊和  
(BANDO, Toshikazu) [JP/JP]; 〒113-0033 東京都 文京  
区 本郷 5-2 1-10 ハイマート大樹 305 号 Tokyo  
(JP). 斎藤 烈 (SAITO, Isao) [JP/JP]; 〒607-8242 京都府  
京都市 山科区 勧修寺 柴山 1-2 1 Kyoto (JP).(74) 代理人: 佐伯 憲生 (SAEKI, Norio); 〒103-0027 東京都  
中央区 日本橋三丁目 1 5 番 2 号 高愛ビル 9 階 Tokyo  
(JP).

(81) 指定国 (国内): US.

(84) 指定国 (広域): ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY,  
CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC,  
NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR).添付公開書類:  
— 国際調査報告書

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 杉山 弘  
(SUGIYAMA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒102-0081 東京都 千2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: NOVEL HAIRPIN POLYAMIDE

(54) 発明の名称: 新規なヘアピン型ポリアミド

(57) Abstract: It is intended to provide a pyrrole-imidazole polyamide type functional molecule having enhanced abilities of alkylating DNA and recognizing a sequence, compared with the existing functional molecules of this type, for a specific base sequence occurring on DNA. A hairpin polyamide having an alkylation site via a vinyl linker at the end of a pyrrole-imidazole polyamide. Drugs for inhibiting the expression of a specific gene and anticancer agents containing the above hairpin polyamide.

(57) 要約: 本発明は、DNA 上に存在する特定の塩基配列に対して、従来のこの種の機能分子よりも更に高い DNA アルキル化能と配列認識能を兼ね備えたピロール-イミダゾールポリアミド系の機能分子を提供することを目的とする。本発明は、ピロール-イミダゾールポリアミドの末端にビニールリンカーを介してアルキル化反応部位を有するヘアピン型ポリアミドに関する。また、本発明は、上記ヘアピン型ポリアミドを含んでなる、特定遺伝子の発現を抑制する薬剤並びに抗ガン性を有する薬剤に関する。

WO 03/076412 A1